

⑤

Int. Cl. 2:

A 61 K 9/68

A 23 G 3/30

⑱ **BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND**

DEUTSCHES



PATENTAMT

DE 28 08 160 A 1

⑪

Offenlegungsschrift 28 08 160

⑫

Aktenzeichen:

P 28 08 160.9

⑬

Anmeldetag:

25. 2. 78

⑭

Offenlegungstag:

30. 8. 79

⑳

Unionspriorität:

㉔

㉕

㉖

⑤④

Bezeichnung:

Neuartige Tablette und das Verfahren zur Herstellung eines solchen Presslings

⑦①

Anmelder:

Nordström, Rabbe, Dr.; Voss, Gunther M.; 8081 Breitbrunn

⑦②

Erfinder:

gleich Anmelder

DE 28 08 160 A 1

Best Available Copy

⊕ 8. 79 909 835/324

3/90

2808160

P A T E N T A N S P R Ü C H E

1. TABLETTE, DADURCH GEKENNZEICHNET, DASS SIE AUS EINEM KAUGUMMIGRANULAT HERGESTELLT IST.
2. KAUGUMMITABLETTE NACH ANSPRUCH 1, DADURCH GEKENNZEICHNET, DASS IN DAS KAUGUMMIGRANULAT WIRKSUBSTANZEN EINGEARBEITET WURDEN.
3. KAUGUMMITABLETTE NACH ANSPRUCH 1, DADURCH GEKENNZEICHNET, DASS DAS KAUGUMMIGRANULAT MIT EINEM ÜBLICHEN TABLETTEN-GRANULAT, DEM WIRKSUBSTANZEN ZUGESETZT WURDEN, GEMEINSAM VERPRESST WIRD.
4. KAUGUMMITABLETTE NACH ANSPRUCH 1, DADURCH GEKENNZEICHNET, DASS DEM GRANULAT ÄTHERISCHE ÖLE ZUGESETZT WURDEN.
5. KAUGUMMITABLETTE NACH ANSPRUCH 1, DADURCH GEKENNZEICHNET, DASS SICH DAS KAUGUMMIGRANULAT IN EINER ODER MEHREREN SCHICHTEN BEFINDET UND DASS ES WEITERE SCHICHTEN AUS ÜBLICHEN, VORZUGSWEISE MIT WIRKSUBSTANZEN ANGEREICHERTEN GRANULATEN GIBT.

909835/0324

ORIGINAL INSPECTED

Best Available Copy

- 8 -
2

6. KAUGUMMITABLETTE NACH ANSPRUCH 1, DADURCH GEKENNZEICHNET, DASS SIE ALS MANTELTABLETTE HERGESTELLT WURDE, WOBEI ENTWEDER DER MANTEL AUS KAUGUMMIGRANULAT BESTEHT ODER DER KERN UND DER REST JEWELNS AUS ÜBLICHEN, VORZUGSWEISE MIT WIRKSUBSTANZEN ANGEREICHERTEN GRANULATEN BESTEHT.
7. VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG EINER KAUGUMMITABLETTE NACH ANSPRUCH 1 BIS 6, DADURCH GEKENNZEICHNET, DASS EINE ÜBLICHE KAUGUMMIMASSE, DER BEKANNTEN VISCOSITÄTEN, ZUM ZWECK DER GRANULATHERSTELLUNG GEKÜHLT WIRD.
8. VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG EINER KAUGUMMITABLETTE NACH ANSPRUCH 1 BIS 6, DADURCH GEKENNZEICHNET, DASS DIE FÜR DIE GRANULATION VORGESEHENE MASSE WIE EIN "NASSGRANULAT" ZERRIEBEN ODER DURCHGEDRÜCKT WIRD, UNTER KONTINUIERLICHER ZUGABE EINER TROCKENEN UND TRENNENDEN SUBSTANZ.
9. VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG EINER KAUGUMMITABLETTE NACH ANSPRUCH 1 BIS 6, DADURCH GEKENNZEICHNET, DASS FÜR DIE HOMOGENE VERPRESSUNG DES GRANULATES KEINE TRENN- UND SCHMIERMITTEL ZUGESETZT WERDEN.

GUNTHER MEINHARD VOSS UND DR. CAI GUSTAV RABBE NORDSTRÖM
BREITBRUNN/AMMERSEE

NEUARTIGE TABLETTE UND DAS VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG
EINES SOLCHEN PRESSLINGS.

DIE ERFINDUNG BETRIFFT EINE NEUARTIGE VERABREICHUNGSFORM,
DIE GANZ ODER TEILWEISE, AUS EINER KAUGUMMIMASSE BESTEHT,
SOWIE DAS VERFAHREN IHRER HERSTELLUNG.

SEIT LANGEM BESTEHT DER WUNSCH, EINE PHARMAKOLOGISCHE
EXAKTE, VOLL REPRODUZIERBARE, VERABREICHUNGSFORM, FÜR DIE
ORALE ABSORPTION VON PHARMAKA ZU FINDEN.

DIES IST VON BESONDERER BEDEUTUNG, WENN MAN DIE, IM VER-
GLEICH ZU DER BEKANNTEN RESORPTION AUS DEM MAGEN-DARMTRAKT,
VERHÄLTNISSMÄSSIG SCHNELLE RESORPTION ÜBER DIE ORALEN SCHLEIM-
HÄUTE VOR AUGEN HÄLT. WEITERHIN IST ZU BEMERKEN, DASS VON
MENSCH ZU MENSCH SEHR ÄHNLICHE VERHÄLTNISSE BEI DER ORALEN
RESORPTION BESTEHEN, IM GEGENSATZ ZUR RESORPTION AUS DEM
MAGEN- UND DARMTRAKT.

ES WURDE NUN VERSUCHT, EINE TABLETTE AUS KAUGUMMIMASSE ZU
SCHAFFEN, DIE ALLE PHARMAKOLOGISCHE ANFORDERUNGEN ERFÜLLT.

KAUGUMMIMASSEN GIBT ES IN DEN VERSCHIEDENSTEN ABFORMUNGEN,
WIE STREIFEN, KISSEN, DPAGEES, VOM STRANG EXTRUDIERT, ALS
KERN-MIT EINER HARTZUCKERDECKE UMGEBEN, FLÜSSIG GEFÜLLT,
ODER SOGAR ALS ZIGARETTEN-IMITATION.

DIE KAUGUMMIBASEN EMPFEHLEN SICH IN HOHEM MASSE ZUR WIRK-
STOFFAUFNahme UND BESONDERS LANG ANHALTENDEN WIRKSTOFFAB-
GABE. DIE GESCHILDERTEN UND HEUTE BEKANNTEN DARBIETUNGS-
FORMEN GARANTIEREN JEDOCH NICHT EXAKT DIE BEI DER TABLETTEN-
HERSTELLUNG GEFORDERTEN MASS- UND GEWICHTSGENAUIGKEITEN
DER ARZNEIMITTELHERSTELLUNG.

- 2 -
4

ES WURDE NUN GEFUNDEN, DASS MAN, UM VON KAUGUMMIMASSEN FERTIGE, ZUR ABFORMUNG PRÄPARIERTE KAUGUMMIMASSEN, DIE THERMOPLASTISCH REAGIEREN EIN, FÜR DIE VERPRESSUNG AUF EXZENTER- ODER ROTATIONSPRESSEN ERFORDERLICHES GRANULAT AUS KAUGUMMIMASSE ERHALTEN KANN, WENN MAN DIE FEPTIGE GRUNDMASSE MIT ALLEN INGREDIENZEN, VORHER AUF CA. 20 MM PLATTENSTÄRKE AUSWALZT UND AUF ETWA MINUS 10 GRAD CELSIUS HERUNKÜHLT. DIE KAUGUMMIMASSE WIRD HART UND SPRÖDE UND EIN FEINSTBRUCH AUF GEEIGNETEN MASCHINEN, ZUM BEISPIEL WALZENSTUHL, HAMMERSCHLAGMÜHLE, IST MÖGLICH.

EINE SO HERGESTELLTE TABLETTE HAT VIELE VORTEILE: ES KÖNNEN DIE FÜR EINE TABLETHERSTELLUNG ÜBLICHEN ANLAGEN, Z.B. WERKZEUGE WIE OBER- UND UNTERSTEMPEL EINSCHLIESSLICH MATRIZE, HERSTELLUNGSMASCHINEN UND VERPACKUNGSSTATIONEN BENUTZT WERDEN. WEITERHIN IST ES MIT DIESER TABLETTE MÖGLICH, WIRKSTOFFE SO ZU VERNETZEN, DASS EIN RETARDIERENDER EFFEKT BEIM KAUFEN ENTSTEHT. EINER SOLCHEN VERWENDUNG, D.H., UNTERBRINGUNG VON WIRKSTOFFSUBSTANZEN IN KAUGUMMIMASSEN UND DEREN BISHER BEKANNTEN ABFORMUNGEN, STAND DIE NICHT GENÜGEND EXAKTE UND REPRODUZIERBARE DOSIERUNG ENTGEGEN.

EINE WEITERE METHODE IST DAS DURCHREIBEN DER NOCH WARMEN KAUGUMMIMASSE MITTELS EINER NASSGRANULIERMASCHINE, Z.B. ALEXANDERWERK-GRANULIERMASCHINE, HUTTGRANULIERER O.Ä., UM EIN GRANULAT ZU ERHALTEN. IN BEIDEN, OBEN ERWÄHNTEN FÄLLEN, IST ES WICHTIG, DAS SONST ÜBLICHE, FÜR DIE VERPRESSUNG VON GRANULAT ZU TABLETTE ERFORDERLICHE TRENN- UND/ODER SCHMIERMittel, NICHT UNTERZUMISCHEN. DIE KAUGUMMITABLETTE WÜRD NACH DER KOMPRESSION SONST AUSEINANDER BRÜCKELN. UM EIN VORZEITIGES ZUSAMMENBACKEN DES PER NASSGRANULATION HERGESTELLTEN KAUGUMMIGRANULATES ZU VERHINDERN, EMPFIEHLT SICH DIE HINZUGABE (KONTINUIERLICH AN DER LOCHWALZE ODER -SCHEIBE ODER IN DIE FERTIGE CHARGE) GEEIGNETER "VERBINDUNGSSUBSTANZEN", Z.B. SACCHAROSE, XYLIT, SORBIT.

-2-
5

UM EIN EINWANDFREIES ABLÖSEN UND HERAUSSTOSSEN DER TABLETTE (NACH DER KOMPRESSION) ZU GEWÄHRLEISTEN, KANN DAS KAUGUMMI-GRANULAT MITTELS DER PRESSKAMMERBESCHICHTUNG HERGESTELLT WERDEN, VORZUGSWEISE UNTER EINSATZ DES PRESSKAMMERBESCHICHTUNGSVERFAHRENS P 27 17 438.5 .

INFOLGE DER SPEZIELLEN VORBEHANDLUNG DER KAUGUMMIMASSE, UM ZU EINEM PRESSFÄHIGEN GRANULAT ZU GELANGEN, UNTER ZUHILFENAHME DER INTERMITTIERENDEN MATRIZEN- UND WERKZEUGBESCHICHTUNG (BZW. BESCHMIERUNG), KÖNNEN ALLE BEKANNTEN FORMEN EINER TABLETTE HERGESTELLT WERDEN, WIE MANTELTABLETTE UND SCHICHTTABLETTE, WOBEI AUCH ÜBLICHE GRANULATE MIT ODER OHNE WIRKSTOFFE, UNTER EINBEZIEHUNG DES KAUGUMMIGRANULATES, VERWENDUNG FINDEN.

DURCH DIE VORLIEGENDE TABLETTE LÄSST SICH AUCH EIN VÖLLIG NEUER EFFEKT REALISIEREN: BITTERE, ARZNEILICHE WIRKSTOFFE, Z.B. IN EINEM DRAGEE UNTERGEBRACHT, LASSEN DEN "ABLAUF" VON SÜSS NACH BITTER ERWARTEN. BEI EINSATZ EINES GESÜSSTEN KAUGUMMIGRANULATES IN VERBINDUNG MIT EINEM ÜBLICHEN GRANULAT (ALS SCHICHT- ODER MANTELTABLETTE), WOBEI DER "KERN" AUS DEM GESÜSSTEN KAUGUMMIGRANULAT BESTEHEN KÖNNTE), HIER Z.B. MIT BITTER (ODER UNANGENEHM-) SCHMECKENDEN, ARZNEILICHEN WIRKSTOFFEN VERSEHEN, WIRD DEN UMGEKEHRTEN EFFEKT, BZW. "ABLAUF" ERGEBEN, D.H., ERST WERDEN DIE BITTERSTOFFE AN DEN GESCHMACKSPAPPILLEN WAHRGENOMMEN, MIT EINER, IMMER STÄRKER WERDENDEN SÜSSEN ÜBERLAGERUNG (DES GESÜSSTEN KAUGUMMIGRANULATES).